

## (12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19)世界知的所有権機関  
国際事務局(43)国際公開日  
2005年6月9日 (09.06.2005)

PCT

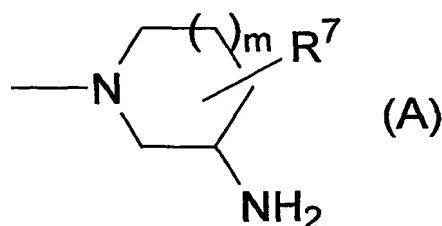
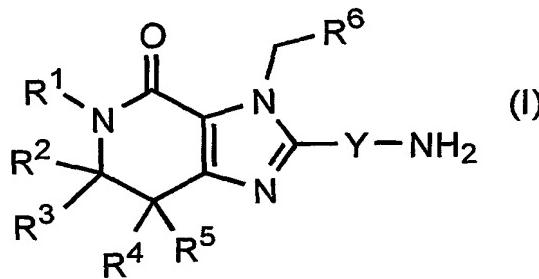
(10)国際公開番号  
WO 2005/051949 A1

- (51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 471/04, A61K 31/4545, 31/5377, A61P 3/10, 43/00
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2004/017828
- (22) 国際出願日: 2004年11月24日 (24.11.2004)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:  
特願 2003-396242 2003年11月26日 (26.11.2003) JP  
特願 2003-419427 2003年12月17日 (17.12.2003) JP
- (71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 住友製薬株式会社 (SUMITOMO PHARMACEUTICALS CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5418510 大阪府大阪市中央区道修町2丁目2番8号 Osaka (JP).
- (72) 発明者; および  
(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 中平 博之 (NAKAHIRA, Hiroyuki) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製薬株式会社内 Osaka (JP). 木村 英憲 (KIMURA, Hidenori) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製薬株式会社内 Osaka (JP). 小林 友則 (KOBAYASHI, Tomonori) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製薬株式会社内 Osaka (JP). 方達 均 (HOCHIGAI, Hitoshi) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製薬株式会社内 Osaka (JP).
- (74) 代理人: 五十部 稔 (ISOBE, Yutaka); 〒5540022 大阪府大阪市此花区春日出中3丁目1番98号 住友製薬株式会社 知的財産部内 Osaka (JP).
- (81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,

/総葉有/

(54) Title: NOVEL CONDENSED IMIDAZOLE DERIVATIVE

(54)発明の名称: 新規縮合イミダゾール誘導体



(57) Abstract: Disclosed is a compound represented by the formula (I) below which has a high DPP-IV inhibitory activity and is improved in safety, toxicity and the like. Also disclosed is a prodrug of such a compound and pharmaceutically acceptable salts of them. [In the formula, R<sup>1</sup> represents a hydrogen atom, an optionally substituted alkyl group or the like; R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> independently represent a hydrogen atom, an optionally substituted alkyl group or the like; R<sup>4</sup> and R<sup>5</sup> independently represent a hydrogen atom, an optionally substituted alkyl group or the like; R<sup>6</sup> represents a hydrogen atom, an optionally substituted aryl group or the like; and -Y-NH<sub>2</sub> represents a group represented by the following formula (A): (wherein m is 0, 1 or 2; and R<sup>7</sup> may not exist or one or two R<sup>7</sup> may exist and independently represent an optionally substituted alkyl group or the like) or the like.]

(57) 要約: DPP-IV阻害活性が高く、安全性、毒性等で改善された化合物として、下記式(1)で表される化合物もしくはそのプロドラッグ、またはそれらの薬学上許容される塩を提供する。[式中、R<sup>1</sup>は水素原子、置換されてもよいアルキル基等を表す。R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、各々独立して、水素原子、置換されてもよいアルキル基等を表す。R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は、各々独立して、水素原子、置換されてもよいアルキル基等を表す。R<sup>6</sup>は水素原子、置換されてもよいアリール基等を表す。-Y-NH<sub>2</sub>は式(A)で表される基等を表す。(mは0、1、または2を表し、R<sup>7</sup>は、存在しないか、1つまたは2つ存在し、各々独立して、置換されてもよいアルキル基等を表す。)]

WO 2005/051949 A1

す。R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、各々独立して、水素原子、置換されてもよいアルキル基等を表す。R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>は、各々独立して、水素原子、置換されてもよいアルキル基等を表す。R<sup>6</sup>は水素原子、置換されてもよいアリール基等を表す。-Y-NH<sub>2</sub>は式(A)で表される基等を表す。(mは0、1、または2を表し、R<sup>7</sup>は、存在しないか、1つまたは2つ存在し、各々独立して、置換されてもよいアルキル基等を表す。)]



BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,  
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,  
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,  
NL, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,  
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,  
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

- (84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,  
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,  
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,

CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,  
IS, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI  
(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE,  
SN, TD, TG).

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイドスノート」を参照。